(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2004年12月29日(29.12.2004)

(10) 国際公開番号 WO 2004/113359 A1

(51) 国際特許分類7: C07H 17/02, A61K 31/7056, 31/706, 45/00, C07D 231/02, A61P 3/00, 3/04, 3/06, 3/10, 9/10, 9/12, 13/12, 43/00

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2004/008695

(22) 国際出願日:

2004年6月15日(15.06.2004)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

2003年6月20日(20.06.2003) 特願2003-175663

(71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): キッセ イ薬品工業株式会社 (KISSEI PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒399-8710 長野県 松本市 芳野 19番48号 Nagano (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 菊地 紀彦 (KIKUCHLNorihiko) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南 安曇郡 穂高町大宇柏原4365-1 キッセイ薬品 工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 藤倉 秀紀 (FUJIKURA, Hideki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南

安曇郡 穂高町大字柏原4365-1 キッセイ薬品 工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 田澤 准 樹 (TAZAWA,Shigeki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県南 安量郡 穂高町大字柏原4365–1 キッセイ薬品 工業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 大和 徳久 (YAMATO,Tokuhisa) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安 最郡 穂高町大字柏原4365-1 キッセイ薬品工 業株式会社 中央研究所内 Nagano (JP). 伊佐治 正幸 (ISAJI,Masayuki) [JP/JP]; 〒399-8304 長野県 南安曇 郡 穂高町大字柏原4365-1 キッセイ薬品工業株 式会社 中央研究所内 Nagano (JP).

- (81) 指定国(表示のない限り、全ての種類の国内保護が 可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(表示のない限り、全ての種類の広域保護が可 能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,

(54) Title: PYRAZOLE DERIVATIVE, DRUG COMPOSITION CONTAINING THE SAME AND PRODUCTION INTERME-DIATE THEREFOR

(54) 発明の名称: ピラゾール誘導体、それを含有する医薬組成物及びその製造中間体

$$Q \xrightarrow{N-N} T \quad (I)$$

(57) Abstract: A pyrazole derivative capable of expressing an excellent human sodium/glucose cotransporter (SGLT) inhibiting activity, which pyrazole derivative is useful as a preventive, progress inhibitor or therapeutic agent for diseases (diabetes mellitus, after-meal hyperglycemia, impaired glucose tolerance, diabetic complications, etc.) attributed to excess introjection of at least one carbohydrate selected from among glucose, fructose and mannose. The pyrazole derivative is represented by the general formula: (I) [R1 is H, a substituted or unsubstituted C1.6 alkyl, etc.; one of Q and T is a group selected from among: and while the other is -Z-Ar (wherein Z is -O-, -S-, etc. and Ar is a substituted or unsubstituted C_{6-to} aryl, etc.), etc.; and R is a substituted or unsubstituted C3-8 cycloalkyl, a substituted or unsubstituted C6-10 aryl, etc.]. There are further provided a pharmacologically acceptable salt of the pyrazole derivative, a prodrug thereof and a drug composition containing them. There are still further provided a medical use thereof and a production intermediate therefor.